(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
4. Dezember 2003 (04.12.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 03/099009 A 1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: A01N 43/54, 43/78, 43/80, C07D 417/12, 413/12, 409/12, 405/12, 401/12, A01N 43/76
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/05160
- (22) Internationales Anmeldedatum:

16. Mai 2003 (16.05.2003)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 102 23 914.2

. 29. Mai 2002 (29.05.2002) DE

- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-SELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHWARZ. Hans-Georg [DE/DE]; Heinenbusch 19e. Langenfeld (DE). Roland ANDREE, [DE/DE]; Dechant-Miebach-Weg 37, 40764 Langenfeld (DE). HOISCHEN, Dorothee [DE/DE]; Hortensienstr. 40474 Düsseldorf (DE). LINKER, Karl-Heinz [DE/DE]; Kurt-Schumacher-Ring 56, 51377 Leverkusen (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestr. 407(4 Langenfeld (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrücker Str. 61, 41470 Neuss (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, 40789 Monheim (DE). PONTZEN, Rolf [DE/DE]; Am Kloster 69, 42799 Leichlingen (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; Legal & Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ. DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM. HR, HU, ID. IL. IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC. LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX. MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL. TJ. TM. TN, TR. TT. TZ, UA, UG, UZ, VC. VN, YU, ZA, ZM. ZW. ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG. CH. CY. CZ. DE. DK. EE. ES. FI. FR. GB. GR. HU. IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF. BJ. CF, CG. CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN. TD. TG)
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: SUBSTITUTED PHENYLURACILS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PHENYLURACILE

- (57) Abstract: The invention relates to novel substituted phenyluracils of general formula (I) wherein A, Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 and R^6 have the designation cited in the description, to a method for producing said phenyluracils, and to the use of the same as plant treating agents.
- (57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (I): in welcherA, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben, Verfahren zu ihrer Herstellung und deren Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel.

WO 03/099009 A1

ISDOCID: <WO | D30000004 | I

BEST AVAILABLE COPY



Veröffentlicht:

mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.



Substituierte Phenyluracile

Die Erfindung betrifft neue substituierte Phenyluracile, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Pflanzenbehandlungsmittel, insbesondere als Herbizide.

Bestimmte substituierte Phenyluracile, die eine den Verbindungen der vorliegenden Erfindung ähnliche Struktur aufweisen, sind bereits bekannt (z.B. EP-A-255 047, EP-A-831 091, EP-A-1 061 075, US-6,207,830). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine besondere Bedeutung erlangt, weil sie verschiedene Nachteile aufweisen.

Es wurden nun neue substituierte Phenyluracile der allgemeinen Formel (I)

15

5

10

in welcher

- A für Alkandiyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 6 Kohlen
 stoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
 - Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO₂ steht,
- R¹ für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁
 C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

- für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,
- 5 R³ für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
 - R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder Halogen steht,
- 10 R⁵ für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und
- für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, R^6 Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C1-C6-Alkoxy-carbonyl, C3-C6-15 Cycloalkyloxy-carbonyl oder C1-C6-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C1-C6-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C1-C4-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C1-C₄-Alkoxy)-C₁-C₄-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C₂-C₆-Alkenyloxycarbonyl oder C2-C6-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls 20 durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C1-C6-alkyl, Carboxy-C1-C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₆-alkyl, Cyano-C₂-C₆-alkenyl, C₆-alkyl, Carboxy-C2-C6-alkenyl oder C1-C4-Alkoxy-carbonyl-C2-C6-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-25 C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocyclyl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen, ausgewählt aus bis zu 5 Stickstoffatomen und/oder bis zu 2 Sauerstoffatomen und/oder bis zu 2 Schwefelatomen sowie 30

SMEDICIDI SMO MANAGAMANTI S



gegebenenfalls mit zusätzlich bis zu 2 -SO-Gruppen, bis zu 2 -SO₂-Gruppen, bis zu 2 -CO-Gruppen oder bis zu 2 -CS-Gruppen steht,

einschließlich der möglichen stereoisomeren Formen

5

gefunden.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkenyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein; wobei bei Mehrfachsubstitution die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

15

10

Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden wie folgt definiert:

- A steht bevorzugt für Alkandiyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2

 20 bis 5 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen.
 - Q steht bevorzugt für O (Sauerstoff), S (Schwefel) oder SO₂.
- R¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano,

 Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoff
 atomen.
 - R² steht bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

- R³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.
- 5 R⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder Iod.
 - R⁵ steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.
 - **R**6 steht bevorzugt für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C1-C5-Alkoxycarbonyl, C₅-C₆-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C₁-C₅-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C1-C4-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C1-C4-alkyl)-aminocarbonyl oder N-(C1-C4-Alkoxy)-C1-C4-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C2-C₅-Alkenyloxy-carbonyl oder C₂-C₅-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C1-C5-alkyl, Carboxy-C₁-C₅-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₅-alkyl, Cyano-C₂-C₅alkenyl, Carboxy-C2-C5-alkenyl oder C1-C4-Alkoxycarbonyl-C2-C5-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocyclyl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen ausgewählt aus bis zu 3 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoffatom und/oder einem Schwefelatom, sowie gegebenenfalls mit zusätzlich einer -SO-Gruppe, einer -SO₂-Gruppe, einer -CO-Gruppe oder einer -CS-Gruppe.

15

20

25

15



- A steht besonders bevorzugt für Alkandiyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen.
- 5 Q steht besonders bevorzugt für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel).
 - R¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl oder n- oder i-Propyl.
- R² steht besonders bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.
 - R³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl oder noder i-Propyl.
- 20 R⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor oder Brom.
 - R⁵ steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen.
- steht besonders bevorzugt für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₅-C₆-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C₁-C₄-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C₁-C₃-alkyl)-

10

15

20

amino-carbonyl oder N-(C₁-C₃-Alkoxy)-C₁-C₃-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C₃-C₄-Alkenyloxy-carbonyl oder C₃-C₄-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano- C_1 - C_3 -alkyl, Carboxy-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Cyano-C₂-C₃-alkenyl, Carboxy-C₂-C₃-alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C2-C3-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes Heterocyclyl aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Benzopyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrazolyl, Benzopyrazolyl, Pyrazolinyl, Imidazolyl, Benzimidazolyl, Imidazolinyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Oxazolinyl, Isoxazolyl, Isoxazolinyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Thiazolinyl, Thiadiazolyl, Triazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl.

- A steht ganz besonders bevorzugt für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,1-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,1-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl.
- Q steht ganz besonders bevorzugt für O (Sauerstoff).
- steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl.
- steht ganz besonders bevorzugt für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl.

10

15

20

25



R³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl.

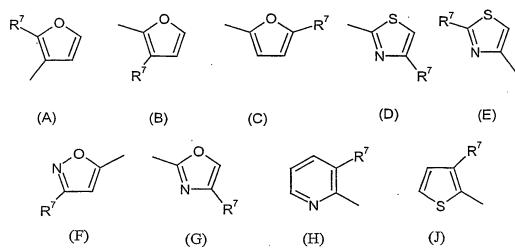
R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor oder Chlor.

- R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy.
- **R**6 steht ganz besonders bevorzugt für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Cyclopentyloxycarbonyl, Cyclohexyloxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl oder N-Methoxy-methylaminocarbonyl, oder durch Propenyloxycarbonyl, Butenyloxy-carbonyl, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind), oder durch Cyanomethyl, Cyanoethyl, Cyanopropyl, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Carboxypropyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, n- oder i-Propoxycarbonylmethyl, Methoxycarbonylethyl, Ethoxycarbonylethyl, n- oder i-Propoxycarbonylethyl, Cyanoethenyl, Carboxyethenyl, Carboxypropenyl, Cyanopropenyl, Methoxycarbonylethenyl, Ethoxycarbonylethenyl, n- oder i-Propoxycarbonylethenyl, Methoxycarbonylpropenyl, Ethoxycarbonylpropenyl, n- oder i-Propoxycarbonylpropenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-

15

oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind) substituiertes Heterocyclyl aus der Reihe Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrazolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Imidazolyl, Oxazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl.

- A steht am meisten bevorzugt für Methylen.
- 10 R¹ steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Amino.
 - R² steht am meisten bevorzugt für Trifluormethyl.
 - R³ steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff.
 - R⁴ steht am meisten bevorzugt für Fluor.
 - R⁵ steht am meisten bevorzugt für Chlor, Brom oder Cyano.
- 20 R⁶ steht am meisten bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen (A) bis (L)





$$R^7$$
 S
 (K)
 (L)

worin

5

15

- R⁷ für Carboxy, Carbamoyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl oder n- oder i-Propoxycarbonyl steht.
- R⁷ steht bevorzugt für Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl.

Erfindungsgemäß bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß am meisten bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als am meisten bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel
(I) in welcher

A für Methylen steht,

	Q	für O (Sauerstoff) steht,				
	\mathbb{R}^1	für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,				
5	R ²	für Cyano oder Trifluormethyl steht,				
	R ³	für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,				
10	R ⁴	für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,				
	R ⁵	für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,				
15	R ⁶	für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Furyl steht.				
20	Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen de Formel (I) in welcher					
	A	für Methylen steht,				
25	Q	für O (Sauerstoff) steht,				
	R ¹	für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,				
	\mathbb{R}^2	für Cyano oder Trifluormethyl steht,				
30	\mathbb{R}^3	für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,				



R ⁴	fiir	Wassersto	ff.	Fluor	oder	Chlor	steht
 _	7	11 40000100		1 1001	~~~		COLLE

- R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,
- für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxy-carbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Oxazolyl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

- A für Methylen steht,
- Q für O (Sauerstoff) steht,
- R¹ für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,
- 20 R² für Cyano oder Trifluormethyl steht,
 - R³ für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,
 - R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
 - R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,
- R⁶ für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxy-carbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy,

10

15

10

20

25

Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Isoxazolyl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

- A für Methylen steht,
- Q für O (Sauerstoff) steht,
- R¹ für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,
- R² für Cyano oder Trifluormethyl steht,
- 15 R³ für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,
 - R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
 - R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,
 - für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxy-carbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Thiazolyl steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I) in welcher

30 A für Methylen steht,

	Q	für O (Sauerstoff) steht,
	\mathbb{R}^1	für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,
5	\mathbb{R}^2	für Cyano oder Trifluormethyl steht,
	R ³	für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,
10	R ⁴	für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
	R ⁵	für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,
15	R ⁶	für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxy carbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zu
		sätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl ode Ethylsulfonyl substituiertes Pyridinyl steht.
20		weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen de lel (I) in welcher
	A	für Methylen steht,
25	Q	für O (Sauerstoff) steht,
	\mathbb{R}^1	für Wasserstoff, Amino oder Methyl steht,
	\mathbb{R}^2	für Cyano oder Trifluormethyl steht,
30	\mathbb{R}^3	für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Methyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R⁵ für Cyano, Thiocarbamoyl, Chlor, Brom oder Trifluormethyl steht,

für durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Thienyl steht.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevor-

zugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Phenyluracile der allgemeinen Formel (I), wenn man Hydroxyphenyl- oder Mercaptophenyluracile der allgemeinen Formel (II)

$$R^2$$
 N
 N
 Q
 R^3
 Q
 R^4
 Q
 R^5

in welcher

Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25



mit substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (III)

5

in welcher

A und R⁶ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

10

X für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkylsulfonyloxy oder Arylsulfonyloxy steht,

15

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

und gegebenenfalls die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der Formel (I) umwandelt.

20

Verwendet man beispielsweise 3-(2,4-Dichlor-5-mercapto-phenyl)-1-methyl-6-tri-fluormethyl-1H-pyrimidin-2,4-dion und 2-Brommethyl-furan-4-carbonsäure-methyl-ester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skiziiert werden:

SUCCIO: SINIC - USUCULUAN + 1

$$F_3C$$
 CH_3
 CH_3

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Hydroxyphenyl- und Mercaptophenyluracile sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ angegeben worden sind.

10

5

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. WO 97/01541, WO 98/54155).

15

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Heterocyclen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) haben A und R⁶ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für A und R⁶ angegeben worden sind; X steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, Iod, gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy



oder gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Methyl substituiertes Phenylsulfonyloxy, insbesondere für Chlor, Brom, Methylsulfonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Tolylsulfonyloxy.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. J. Chem. Soc., Chem. Commun. 19 (1996), 2251-2252; J. Med. Chem. 38 (1995), 4806-4820; Tetrahedron 54 (1998), 7525-7538; Dokl. Akad. Nauk. Arm. SSR 17 (1953), 97-103; Organic Process Research & Development 5 (2001), 37-44).

10

5

Man erhält die substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (III), wenn man beispielsweise Alkylheterocyclen der allgemeinen Formel (IV)

15

in welcher

A und R⁶ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit Halogenierungsmitteln, wie z.B. N-Brom-succinimid oder N-Chlor-succinimid, vorzugsweise in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. 2,2'-Azobis-2-methyl-propannitril, und vorzugsweise in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Tetrachlormethan, bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C umsetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

25

Die substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (IV) sind bekannte organische Synthesechemikalien.



Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel für das erfindungsgemäße Verfahren kommen im Allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kaliumoder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natriumoder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -tbutanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2.2.2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4.3.0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-en (DBU).

20

25

30

5

10

15

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines Verdünnungsmittels durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid,

10

15

20



N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, das erfindungsgemäße Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe im Allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuss zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im Allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

25

30

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden, beispielsweise Verbindungen, bei denen R¹ für Wasserstoff steht, in entsprechende Verbindungen, bei denen R¹ für Amino steht, durch Umsetzung mit geeigneten Aminierungsmitteln, wie z.B. 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol (vgl. Herstellungsbeispiel) oder in entsprechende Verbindungen, bei denen R¹ für Methyl

15

20

25

30

steht, durch Umsetzung mit Dimethylsulfat oder Methylbromid (vgl. Herstellungsbeispiel).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

<u>Dikotyle Unkräuter der Gattungen:</u> Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

<u>Dikotyle Kulturen der Gattungen:</u> Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.



Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuss-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauflauf- als auch im Nachauflauf-Verfahren.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und pilzlichen oder bakteriellen Pflanzenkrankheiten verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie er-

10

15

20

10

15

wünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

25

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.



Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

10

15

20

5

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängeln; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

25

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

SDOCID: WO DRODDON I

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

5

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden und/oder mit Stoffen, welche die Kulturpflanzen-Verträglichkeit verbessern ("Safenern") zur Unkrautbekämpfung verwendet werden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind. Es sind also auch Mischungen mit Unkrautbekämpfungsmitteln möglich, welche ein oder mehrere bekannte Herbizide und einen Safener enthalten.

15

20

25

10

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise Acetochlor, Acifluorfen (-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim (-sodium), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Beflubutamid, Benazolin (-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron (-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop (-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac (-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil (-allyl), Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone (-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cinidon (-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop (-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-methyl), Cloransulam (-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop (-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Dichlorprop (-P), Diclofop (-methyl), Diclosulam, Diethatyl (-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr,

10

15

20

25

30

Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron (-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop (-Pethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L, -methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone (-sodium), Flufenacet, Flufenpyr, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpyrsulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl), Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypropyl, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet (-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate (-ammonium), Glyphosate (-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop (-ethoxyethyl, -P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz (-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron (-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Ketospiradox, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, Mecoprop, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-) Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron (-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Penoxysulam, Pentoxazone, Pethoxamid, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron (-methyl), Profluazol, Profoxydim, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propoxycarbazone (-sodium), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac (-methyl), Pyrithiobac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbuthylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.

10

15

20

25

30

Für die Mischungen kommen weiterhin bekannte Safener in Frage, beispielsweise AD-67, BAS-145138, Benoxacor, Cloquintocet (-mexyl), Cyometrinil, 2,4-D, DKA-24, Dichlormid, Dymron, Fenclorim, Fenchlorazol (-ethyl), Flurazole, Fluxofenim, Furilazole, Isoxadifen (-ethyl), MCPA, Mecoprop (-P), Mefenpyr (-diethyl), MG-191, Oxabetrinil, PPG-1292, R-29148.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene



Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden, gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

5

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften ("Traits"), die durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese, oder auch durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

10

15

20

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel - auch in Kombination mit anderen agrochemischen Wirkstoffen, besseres Wachstum der Kulturpflanzen, erhöhte Toleranz der Kulturpflanzen gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz der Kulturpflanzen gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

25

30

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit

10

15

20

25

30

oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus Bacillus thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden "Bt Pflanzen" genannt). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinothricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid-tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen

10

15

20



Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinothricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid-resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel I bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden, wobei zusätzlich zu der guten Bekämpfung der Unkrautpflanzen die oben genannten synergistischen Effekte mit den transgenen Pflanzen oder Pflanzensorten auftreten. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam.

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

10

15

20

25

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitonal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt

10

15



oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Die Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam.

Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gelund Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:

Beispiel 1

5

Eine Mischung aus 7,50 g (20,3 mMol) 3-(4-Brom-2-fluor-5-hydroxy-phenyl)-6-tri-fluormethyl-1H-pyrimidin-2,4-dion, 4,45 g (20,3 mMol) 3-Brommethyl-furan-2-carbonsäure-methylester, 5,6 g (40,6 mMol) Kaliumcarbonat und 120 ml Acetonitril wird 6 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird die Mischung auf etwa die gleiche Volumenmenge 2N-Salzsäure gegossen und mit Essigsäureethylester geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeengt und der Rückstand säulenchromatografisch (Kieselgel, Methylenchlorid/Essigsäureethylester, Vol.: 95/5) aufgearbeitet.

15

10

Man erhält 5,80 g (55 % der Theorie) 3-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxymethyl]-furan-2-carbonsäure-methylester.



Beispiel 2

(Folgeumsetzung)

5

Eine Mischung aus 2,50 g (4,93 mMol) 3-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxymethyl]-furan-2-carbonsäure-methylester, 0,82 g (5,92 mMol) Kaliumcarbonat und 65 ml Acetonitril wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) 10 Minuten gerührt und dann mit einer Lösung von 0,75 g (5,92 mMol) Dimethylsulfat in 5 ml Acetonitril unter Rühren tropfenweise versetzt. Die Reaktionsmischung wird dann 2 Stunden bei 45°C gerührt, anschließend auf etwa die doppelte Menge Wasser gegossen und mit Methylenchlorid geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeengt, der Rückstand mit Hexan verrührt und das kristallin anfallende Produkt durch Absaugen isoliert.

15

10

Man erhält 2,2 g (79 % der Theorie) 3-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-3-methyl-4-trifluor-methyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxymethyl]-furan-2-carbon-säure-methylester.

20

LogP(pH 2,3) = 3,34.

Beispiel 3

$$F_3C$$
 NH_2
 NH_2

(Folgeumsetzung)

5

10

15

3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxymethyl]-furan-3-carbonsäure-methylester, 0,50 g (5,92 mMol) Natriumhydrogencarbonat und 50 ml N,N-Dimethyl-formamid wird bei Raumtemperatur (ca. 20°C) 10 Minuten gerührt und dann mit 1,18 g (5,92 mMol) 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol innerhalb von 6 Stunden - auf kleine Portionen aufgeteilt - versetzt. Die Reaktionsmischung wird 15 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann werden weitere 0,60 g 1-Aminooxy-2,4-dinitro-benzol dazu gegeben und die Mischung wird weitere 15 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird auf etwa das doppelte Volumen Wasser gegossen und dann mit Essigsäureethylester geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter ver-

mindertem Druck eingeengt und der Rückstand säulenchromatografisch (Kieselgel,

Eine Mischung aus 2,50 g (4,93 mMol) 2-[2-Brom-5-(2,6-dioxo-4-trifluormethyl-

20 Man erhält 1,0 g (39 % der Theorie) 2-[2-Brom-5-(3-amino-2,6-dioxo-4-trifluor-methyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-4-fluor-phenoxymethyl]-furan-3-carbon-säure-methylester.

Hexan/Essigsäureethylester, Vol.: 2/1) aufgearbeitet.

LogP (pH 2,3) = 3,00.

, 5

Analog zu den Beispielen 1 bis 3 und entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

Bsp Nr.	A	Q	\mathbb{R}^{1}	\mathbb{R}^2	\mathbb{R}^3	R ⁴	R ⁵	\mathbb{R}^6	Physikal. Daten
4	CH ₂	o o	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	N CH ₃	Dateii
5	CH ₂	Ο	CH₃	CF₃	H	F	Br	N CH,	logP = 2,77
6	CH ₂	Ο	NH ₂	CF ₃	H	F	Br	CH ₃	logP = 2,47
7	CH ₂	Ο	CH ₃	CF₃	H	F	Br	N CH ₃	logP = 2,97
8	CH ₂	Ο	NH ₂	CF₃	Н	F	Br	N CH ₃	logP = 2,68

JSDOCID- ZWO DROGODOS 1 I

Bsp		T						_	Physikal.
Nr.	Α	Q	\mathbb{R}^1	\mathbb{R}^2	\mathbb{R}^3	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Daten
9	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Cl	CH ₃	
10	CH ₂	0	Н	CF ₃	H	F	CI	CH ₃	
11	CH ₂	0	Н	CF ₃	H	F	Br	H ₃ C, 0	logP = 2,73
12	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Br	H ₃ C	logP = 2,64
13	CH ₂	0	Н	CF ₃	H	F	Br	C ₂ H ₅	
14	CH ₂	0	CH ₃	CF ₃	H	F	Br	H ₃ C,	logP = 3,32
15	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Br	N OH	
16	CH ₂	0	CH ₃	CF ₃	H	F	Br	O N C ₂ H ₅	logP = 3,34
17	CH ₂	О	NH ₂	CF ₃	H	F	Br	H ₃ C	logP = 2,88

Bsp				Γ		T .	Γ		Physikal.
Nr.	Α	Q	\mathbb{R}^1	R ²	\mathbb{R}^3	R^4	R ⁵	\mathbb{R}^6	Daten
18	CH ₂	Ô	CH ₃	CF ₃	H	F	Br	H ₃ C	logP = 3,20
19	CH ₂	О	NH ₂	CF₃	H	F	Cl	N CH ₃	logP = 2,39
20	CH ₂	0	CH ₃	CF ₃	H	F	Cl	N CH ₃	logP = 2,67
21	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃ .	H	F	Cl	N CH ₃	logP = 2,61
22	CH ₂	O	СН₃	CF ₃	H	F	Cl	N CH ₃	logP = 2,90
23	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Cl	H ₃ C, 0	
24	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Cl .	0 H ₃ C-0	logP = 2,67
25	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Cl	S OH	
26	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Cl ·	O C ₂ H ₅	logP = 2,73

Bsp			T			T			Physikal.
Nr.	A	Q	\mathbb{R}^1	\mathbb{R}^2	\mathbb{R}^3	R ⁴	\mathbb{R}^5	R ⁶	Daten
27	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	CI	H ₃ C	logP = 2,58
28	CH₂	О	CH₃	CF ₃	H	F	Br	S CH ₃	logP = 3,09
29	CH ₂	О	CH₃	CF ₃	H	F	Cl	H ₃ C, 0	logP = 3,27
30	CH ₂	О	NH ₂	CF ₃	H	F	Cl	H ₃ C,	logP = 2,94
31	CH ₂	0	CH ₃	CF ₃	H	F	C1	H ₃ C-0	logP = 3,26 a)
32	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃	H.	F	C1	O C ₂ H ₅	logP = 2,98
33	CH ₂	О	CH ₃	CF ₃	H	F	C1	O_N C ₂ H ₅	logP = 3,28
34	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃	H	F	C1	H ₃ C O	logP = 2,82

Bsp			<u> </u>	T]			Physikal.
Nr.	A	Q	\mathbb{R}^1	R ²	\mathbb{R}^3	\mathbb{R}^4	R ⁵	\mathbb{R}^6	Daten
35	CH ₂	0	CH₃	CF₃	H	F	Cl	H ₃ C	
36	CH ₂	0	CH ₃	CF₃	Н	F	Cl	S CH ₃	logP = 3,00
37	CH ₂	0	СӉ₃	CF ₃	H	F	CN	H ₃ C O	logP = 2,91 a)
38	CH ₂	0	CH ₃	CF₃	H	F	CN	H ₃ C	logP = 2,79 a)
39	CH ₂	О	CH₃	CF₃	Н	F	CN	H ₃ CO	$\log P = 2,89^{a}$
40	CH ₂	О	CH₃	CF ₃	H	F	Cl	O CH ₃	
41	CH ₂	0	CH₃	CF ₃	H	·F ·,	Br	O CH ₃	$\log P = 1,62^{a}$
42	CH ₂	О	CH ₃	CF ₃	H	F	CN	O CH ₃	

Bsp		<u> </u>		T	Γ	Ţ			Physikal.
Nr.	A	Q	\mathbb{R}^1	\mathbb{R}^2	\mathbb{R}^3	R ⁴	R ⁵	\mathbb{R}^6	Daten
43	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	Cl	O-CH ₃	
44	CH ₂	Ο	NH ₂	CF₃	H	F	Cl	O_CH ₃	
45	CH ₂	0	Н	CF₃	Н	F	Br	O-CH ₃	
46	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃	H	F	Br	O-CH ₃	$logP = 2,61^{a}$
47	CH ₂	0	H	CF ₃	H	F	CN	CH ₃	
48	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃	H	F	CN	O-CH ₃	
49	CH ₂	· O	H	CF ₃	H	F	Cl	CH ₃	·
50	CH ₂	Ο	CH₃	CF ₃	H	F	Cl	CH ₃	$\log P = 3,71^{a}$
51	CH ₂	Ο	NH ₂	CF ₃	H	F	Cl	CH ₃	$logP = 3,36^{a}$
52	CH ₂	0	Н	CF ₃	H	F	Br	CH ₃	

Bsp		Г		T					Physikal.
Nr.	A	Q	\mathbb{R}^1	R^2	\mathbb{R}^3	R ⁴	R^5	\mathbb{R}^6	Daten
53	CH ₂	0	CH₃	CF ₃	Н	F	Br	CH ₃	$logP = 3,80^{a}$
54	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃	Н	F	Br	CH ₃	$logP = 3,44^{a}$
55	CH ₂	O	Н	CF ₃	H	F	C1	S CH ₃	
56	CH ₂	0	CH ₃	CF₃	H	F	C1	S O-CH ₃	$\log P = 4,45^{a)}$
57	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃	H	F.	Cl	S O CH ₃	$logP = 3,13^{a}$
58	CH ₂	0	Н	CF₃	H	F	Br	S CH ₃	
59	CH₂	0	CH ₃	CF ₃	Н	F	Br	S O CH ₃	$logP = 3,52^{a}$
60	CH ₂	0	NH ₂	CF ₃	H	F	Br	S O-CH ₃	

Die Bestimmung der in der Tabelle angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

- (a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90 % Acetonitril entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit a) markiert.
- 5 (b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.
- Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).
 - Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Ausgangsstoffe der Formel (III):

Beispiel III-1

20

25

15

Eine Mischung aus 26,0 g (185,5 mMol) 3-Methyl-furan-2-carbonsäure-methylester, 33,0 g (185,5 mMol) N-Brom-succinimid (NBS), einer Spatelspitze 2,2'-Azobis-2-methyl-propannitril und 150 ml Tetrachlormethan wird 15 Stunden unter Rückfluß erhitzt und anschließend filtriert. Das Filtrat wird durch Destillation unter vermindertem Druck aufgearbeitet.



Man erhält 24,7 g (50 % der Theorie) 3-Brommethyl-furan-2-carbonsäure-methylester.

Siedebereich: 62-64°C (0,1 Torr).

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel:

5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

- 10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.
- 15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, dass die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

25

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

> 0% = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 2, 3, 5, 6, 14, 17, 18, 19, 28, 29, 30, 31, 34, 35 und 36 bei zum Teil guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, Soja und Weizen, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

יו ו בשפטטטטט ו השיבות האים הוארושה



Beispiel B

Post-emergence-Test

5 Lösungsmittel:

10

15

5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte. Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

20 Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle) 100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 14, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35 und 36 bei zum Teil guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Weizen und Zuckerrüben, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel (I)

in welcher

- A für Alkandiyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- Q für O (Sauerstoff), S (Schwefel), SO oder SO₂ steht,
- R¹ für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- R² für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,
- R³ für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

25

5

10

15

10

15

20



R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder Halogen steht,

R⁵ für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, und

 \mathbb{R}^6 für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C₁-C₄-Alkoxy)-C₁-C₄-alkylamino-carbonyl, oder durch C₂-C₆-Alkenyloxy-carbonyl oder C₂-C₆-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C₁-C₆-alkyl, Carboxy-C₁-C₆-C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₆-alkyl, Cyano-C₂-C₆-alkenyl, Carboxy-C₂-C₆-alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₂-C₆-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocyclyl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen, ausgewählt aus bis zu 5 Stickstoffatomen und/oder bis zu 2 Sauerstoffatomen und/oder bis zu 2 Schwefelatomen sowie gegebenenfalls mit zusätzlich bis zu 2 -SO-Gruppen, bis zu 2 -SO₂-Gruppen, bis zu 2 -CO-Gruppen oder bis zu 2 -CS-Gruppen steht,

einschließlich der möglichen stereoisomeren Formen.

10

15

20

Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, 2. dass für Alkandiyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 5 A Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen steht, für O (Sauerstoff), S (Schwefel) oder SO2 steht, Q für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Halogen R^1 oder C1-C4-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gege- R^2 benenfalls durch Cyano, Halogen oder C1-C4-Alkoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht, für Wasserstoff, Halogen oder gegebenenfalls durch Halogen substitu- \mathbb{R}^3 iertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, R⁴ Brom oder Iod steht, für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen oder jeweils R^5 25 gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, und für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, R6 Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C1-C5-Alkoxy-30 carbonyl, C5-C6-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C1-C5-Alkylamino-

10

15

25



carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C₁-C₄-Alkoxy)-C₁-C₄-alkylamino-carbonyl, oder durch C2-C5-Alkenyloxy-carbonyl oder C2-C5-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C₁-C₅-alkyl, Carboxy-C₁-C₅-C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₅-alkyl, Cyano-C₂-C₅-alkenyl, Carboxy-C₂-C₅-alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₂-C₅-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes, monocyclisches oder bicyclisches Heterocyclyl mit bis zu 9 Kohlenstoffatomen und bis zu 5 Heteroatomen ausgewählt aus bis zu 3 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoffatom und/oder einem Schwefelatom, sowie gegebenenfalls mit zusätzlich einer -SO-Gruppe, einer -SO2-Gruppe, einer -CO-Gruppe oder einer -CS-Gruppe steht.

- 20 3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass
 - A für Alkandiyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkendiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkindiyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
 - Q für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,
- R¹ für Wasserstoff, Amino oder gegebenenfalls durch Cyano, Fluor,
 Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl oder n- oder
 i-Propyl steht,

\mathbb{R}^2	für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gege-
	benenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-
	Propoxy substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils 1 bis 3
	Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

- R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl oder n- oder i-Propyl steht,
- R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor oder Brom steht,
- R⁵ für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht, und
- für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₅-C₆-Cycloalkyloxy-carbonyl oder C₁-C₄-Alkylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Di-(C₁-C₃-alkyl)-amino-carbonyl oder N-(C₁-C₃-Alkoxy)-C₁-C₃-alkyl-amino-carbonyl, oder durch C₃-C₄-Alkenyloxy-carbonyl oder C₃-C₄-Alkinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), oder durch Cyano-C₁-C₃-alkyl, Carboxy-C₁-C₃-alkenyl, Carboxy-C₂-C₃-alkenyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₂-C₃-alkenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Halogen oder durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-

5

15

20

25

15



C₄-Alkylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind) substituiertes Heterocyclyl aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Benzopyrazolyl, Pyrrolinyl, Pyrazolyl, Benzopyrazolyl, Pyrazolinyl, Imidazolyl, Benzimidazolyl, Imidazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Oxazolinyl, Isoxazolyl, Isoxazolinyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Thiazolyl, Thiazolyl, Thiazolyl, Pyrimidinyl, Triazinyl steht.

- 10 4. Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass
 - A für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl (Dimethylen), Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Ethen-1,1-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,1-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl steht,
 - Q für O (Sauerstoff) steht,
- 20 R¹ für Wasserstoff, Amino oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl steht,
- für Carboxy, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl oder jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl steht,
 - R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl steht,
 - R⁴ für Wasserstoff, Cyano, Fluor oder Chlor steht,

 R^6

R⁵ für Nitro, Cyano, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom oder jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht, und

für über ein Kohlenstoffatom mit A verbundenes, durch Cyano,

5

10

15

20

25

Carboxy, Carbamoyl oder Thiocarbamoyl, oder durch Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Cyclopentyloxycarbonyl, Cyclohexyloxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylamino-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl substituiert sind), oder durch Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl oder N-Methoxy-methylaminocarbonyl, oder durch Propenyloxycarbonyl, Butenyloxy-carbonyl, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind), oder durch Cyanomethyl, Cyanoethyl, Cyanopropyl, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Carboxypropyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, n- oder i-Propoxycarbonylmethyl, Methoxycarbonylethyl, Ethoxycarbonylethyl, n- oder i-Propoxycarbonylethyl, Cyanoethenyl, Cyanopropenyl, Carboxyethenyl, Carboxypropenyl, Methoxycarbonylethenyl, Ethoxycarbonylethenyl, n- oder i-Propoxycarbonylethenyl, Methoxycarbonylpropenyl, Ethoxycarbonylpropenyl, n- oder i-Propoxycarbonylpropenyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), und gegebenenfalls zusätzlich durch Nitro, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind) substituiertes

Heterocyclyl aus der Reihe Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyra-

zolyl, Pyrazolinyl, Imidazolyl, Imidazolinyl, Oxazolyl, Oxazolinyl, Isoxazolyl, Isoxazolinyl, Thiazolyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl steht.

- 5 Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass
 - A für Methylen steht,
- 10 R¹ für Wasserstoff, Methyl oder Amino steht,
 - R² für Trifluormethyl steht,
 - R³ für Wasserstoff steht,
 - R⁴ für Fluor steht,
 - R⁵ für Chlor, Brom oder Cyano steht, und
- 20 R⁶ für eine der folgenden Gruppierungen (A) bis (L) steht

$$R^7$$
 O R^7 R^7 (A) (B) (C)

$$\begin{array}{c|c}
S & R^7 & S \\
N & N & N
\end{array}$$

(D) (E)

$$\mathbb{R}^7$$
 \mathbb{R}^7 \mathbb{R}^7

worin

5

10

- R⁷ für Carboxy, Carbamoyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl oder noder i-Propoxycarbonyl steht.
- 6. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (II)

$$R^2$$
 N
 O
 H
 O
 R^3
 O
 R^4
 O
 R^5

in welcher

- Q, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,
- 20 mit substituierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (III)



A R

(III)

in welcher

5

A und R⁶ die in einem der Ansprüche 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben und

10

X für Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkylsulfonyloxy oder Arylsulfonyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umsetzt,

15

und gegebenenfalls die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der Formel (I) umwandelt.

20

- 7. Mittel, gekennzeichnet durch den Gehalt mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 und üblichen Streckmitteln.
- 8. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 oder eines Mittels gemäß Anspruch 7 zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen und/oder Arthropoden.

25

 Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Pflanzen und/oder Arthropoden, dadurch gekennzeichnet, dass man mindestens eine Verbindung der Formel
 (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 oder ein Mittel gemäß Anspruch 7 auf



Internatio plication No PCT/E-3/05160

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A01N43/54 A01N43/78

C07D409/12

C07D405/12

A01N43/80 CO7D401/12 CO7D417/12 A01N43/76

C07D413/12

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCONII	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, o	f the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 98 06706 A (DREWES MARK WI ROLAND (DE); BAYER AG (DE); D 19 February 1998 (1998-02-19) the whole document	1-9	
X	WO 96 07323 A (BAYER AG ;SANT JOACHIM (DE); DOLLINGER MARKU ANDREE) 14 March 1996 (1996-0 , sentence W	S (DE):	1-9
X	DE 44 37 197 A (BAYER AG) 25 April 1996 (1996-04-25) the whole document		1-9
Y	WO 02 34725 A (DREWES MARK WI ROLAND (DE); FEUCHT DIETER (D 2 May 2002 (2002-05-02) the whole document	LHELM ;ANDREE E); SCHNE)	1-9
χ Furth	er documents are listed in the continuation of box C.	χ Patent family members are listed	in annex.
A' documer conside E' earlier de filing da L' documer which is citation O' documer other m P' documer later tha	at which may throw doubts on priority claim(s) or s clied to establish the publication date of another or other special reason (as specified) at referring to an oral disclosure, use, exhibition or	"T" later document published after the inte or priority date and not in conflict with cited to understand the principle or the invention "X" document of particular relevance; the cannot be considered novel or cannot involve an inventive step when the document of particular relevance; the cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or moments, such combined with one or moments, such combination being obvious in the art. "&" document member of the same patent in the art. Date of mailing of the international seasons are patent in the art.	the application but every underlying the laimed invention be considered to current is taken alone laimed invention eventive step when the re other such docusis to a person skilled family
	alling address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk	29/08/2003 Authorized officer	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Internation No
PCT/EP U3/05160

		PCT/EP US	/05160
	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages		Relevant to claim No.
Υ	EP 1 061 075 A (ROHM & HAAS) 20 December 2000 (2000-12-20) cited in the application the whole document		1-9
Y	the whole document WO 01 77084 A (DREWES MARK WILHELM ;LINKER KARL HEINZ (DE); ANDREE ROLAND (DE); F) 18 October 2001 (2001-10-18) the whole document		1-9

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

n on patent family members

PCT/E. /05160

					017 L	0 00100
Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 9806706	A	19-02-1998	DE	19632005	Α1	12-02-1998
5000700	,,	10 02 1000	AU	718868		20-04-2000
			AU	3771497		06-03-1998
			BR	9711033		17-08-1999
			CN	1227548		01-09-1999
			DE	59708449		14-11-2002
			DK	923562		10-02-2003
			MO	9806706		19-02-1998
			EP	0923562		23-06-1999
			ES	2181015		16-02-2003
			JP	2001503021		06-03-2001
			US 	6130225	A 	10-10-2000
WO 9607323	Α	14-03-1996	DE	4431219		07-03-1996
			ΑU	3471595		27-03-1996
			BR	9508690		26-05-1998
			CN	1370406	Α	25-09-2002
			CN	1156394	A ,B	06-08-1997
			WO	9607323	A1	14-03-1996
			EP	0778732	A1	18-06-1997
			JP	10505072	T	19-05-1998
			US	5990044	A	23-11-1999
DE 4437197	 А	25-04-1996	DE	4437197	 A1	25-04-1996
			BR	9504450		20-05-1997
			CN	1129517		28-08-1996
			JP	8208412		13-08-1996
WO 0234725	Α	02-05-2002	DE	10051981	 А1	02-05-2002
			ΑU	2360402		06-05-2002
			WO	0234725		02-05-2002
			EP	1330443		30-07-2003
EP 1061075	Α	20-12-2000	AU	3783100	 А	21-12-2000
		-	BR	0002759		30-01-2001
			ĒΡ	1061075		20-12-2000
			ĴΡ	2001031678		06-02-2001
			US	6258751		10-07-2001
WO 0177084		18-10-2001	DE	10016893	 А1	18-10-2001
110 0277001	, ,	10 10 1001	ΑŪ	5473101		23-10-2001
			BR	0109784		21-01-2003
			CA	2404759		02-10-2002
			CN	1420873		28-05-2003
			WO	0177084		18-10-2001
						08-01-2003
			F D			
			EP US	1272478 2002173425		21-11-2002

INTERNATIONALER_RECHERCHENBERICHT

internation Aktenzeichen PCT/ **03/05160**

a. Klassifizierung des anmeldungsgegenstandes IPK 7 A01N43/54 A01N43/78

C07D409/12

C07D405/12

A01N43/80 C07D401/12 CO7D417/12 A01N43/76

C07D413/12

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchlerter Mindestprütstoff (Klasslfikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 A01N C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Geblete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 98 06706 A (DREWES MARK WILHELM ;ANDREE ROLAND (DE); BAYER AG (DE); DOLLINGER) 19. Februar 1998 (1998-02-19) das ganze Dokument	1-9
(WO 96 07323 A (BAYER AG ;SANTEL HANS JOACHIM (DE); DOLLINGER MARKUS (DE); ANDREE) 14. März 1996 (1996-03-14) , Satz W	1–9
(DE 44 37 197 A (BAYER AG) 25. April 1996 (1996-04-25) das ganze Dokument	1-9
	WO 02 34725 A (DREWES MARK WILHELM; ANDREE ROLAND (DE); FEUCHT DIETER (DE); SCHNE) 2. Mai 2002 (2002-05-02) das ganze Dokument	1–9

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C z entnehmen	Feld C zu
--	-----------

Siehe Anhang Patentfamilie

- Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen
- Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zwelfelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung
- veröntenmenting, die sich auf eine mindichte Gnehoerung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erlindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

21. August 2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2

Europaisines r dismann, 15. 3010 1 20

29/08/2003

Bevollmächtigter Bedlensteter

Von Daacke, A

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)



PCT 03/05160

		3/05160	
.(Fortsetz	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		La
(ategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommer	nden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 1 061 075 A (ROHM & HAAS) 20. Dezember 2000 (2000-12-20) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument		1-9
Y	WO 01 77084 A (DREWES MARK WILHELM; LINKER KARL HEINZ (DE); ANDREE ROLAND (DE); F) 18. Oktober 2001 (2001-10-18) das ganze Dokument		1-9

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen,

elben Patentfamilie gehören

Internatio klenzeichen PCT/EP 03/05160

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokume	ent	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9806706	A	19-02-1998	DE AU AU BR CN DE DK WO EP ES JP US	19632005 A1 718868 B2 3771497 A 9711033 A 1227548 A 59708449 D1 923562 T3 9806706 A1 0923562 A1 2181015 T3 2001503021 T 6130225 A	12-02-1998 20-04-2000 06-03-1998 17-08-1999 01-09-1999 14-11-2002 10-02-2003 19-02-1998 23-06-1999 16-02-2003 06-03-2001 10-10-2000
WO 9607323	A	14-03-1996	DE AU BR CN CN WO EP JP	4431219 A1 3471595 A 9508690 A 1370406 A 1156394 A ,E 9607323 A1 0778732 A1 10505072 T 5990044 A	07-03-1996 27-03-1996 26-05-1998 25-09-2002 3 06-08-1997 14-03-1996 18-06-1997 19-05-1998 23-11-1999
DE 4437197	Α	25-04-1996	DE BR CN JP	4437197 A1 9504450 A 1129517 A 8208412 A	25-04-1996 20-05-1997 28-08-1996 13-08-1996
WO 0234725	A	02-05-2002	DE AU WO EP	10051981 A1 2360402 A 0234725 A1 1330443 A1	02-05-2002 06-05-2002 02-05-2002 30-07-2003
EP 1061075	A	20-12-2000	AÙ BR EP JP US	3783100 A 0002759 A 1061075 A2 2001031678 A 6258751 B1	21-12-2000 30-01-2001 20-12-2000 06-02-2001 10-07-2001
WO 0177084	A	18-10-2001	DE AU BR CA CN WO EP US	10016893 A1 5473101 A 0109784 A 2404759 A1 1420873 T 0177084 A1 1272478 A1 2002173425 A1	18-10-2001 23-10-2001 21-01-2003 02-10-2002 28-05-2003 18-10-2001 08-01-2003 21-11-2002

THIS PAGE BLANK (USPT 2)

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

☐ BLACK BORDERS
IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
☐ FADED TEXT OR DRAWING
BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
Потибр.

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPT 2)